



①9 BUNDESREPUBLIK  
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES  
PATENT- UND  
MARKENAMT

⑫ **Offenlegungsschrift**  
⑩ **DE 101 28 910 A 1**

⑥ Int. Cl.<sup>7</sup>:  
**A 61 K 7/48**

⑳ Aktenzeichen: 101 28 910.3  
㉔ Anmeldetag: 15. 6. 2001  
㉕ Offenlegungstag: 19. 12. 2002

DE 101 28 910 A 1

㉑ Anmelder:  
Beiersdorf AG, 20253 Hamburg, DE

㉒ Erfinder:  
Sauermann, Kirsten, Dr., 10999 Berlin, DE;  
Sauermann, Gerhard, Dr., 24649 Wiemersdorf, DE;  
Jaspers, Sören, 22869 Schenefeld, DE; Ennen,  
Joachim, Dr., 22397 Hamburg, DE; Maerker, Urte,  
22085 Hamburg, DE; Wepf, Roger, Dr., 22455  
Hamburg, DE; Schimpf, Ralf, Dr., 25474  
Bönningstedt, DE; Filbry, Alexander, Dr., 22459  
Hamburg, DE; Schreiner, Volker, Dr., 20259  
Hamburg, DE

⑤⑥ Für die Beurteilung der Patentfähigkeit in Betracht  
zu ziehende Druckschriften:

EP	01 47 282 A2
WO	98 33 494 A1
WO	98 22 075 A1
WO	01 13 865 A1
WO	00 07 607 A1

JP 2001139447 A., In: Patent Abstracts of Japan;

**Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen**

- ⑤4 Verwendung von Wirkstoffkombinationen aus Arginin und Ascorbinsäure zur Hautstraffung  
⑤7 Verwendung von Wirkstoffkombinationen aus Arginin und Ascorbinsäure zur Herstellung kosmetischer oder dermatologischer Zubereitungen zur Straffung und/oder Festigung der Haut.

01 28 910 A 1

# DE 101 28 910 A 1

## Beschreibung

[0001] Die vorliegende Erfindung betrifft kosmetische bzw. dermatologische Zubereitungen, enthaltend Wirkstoffe zur Pflege und zum Schutze der Haut, insbesondere der empfindlichen Haut wie auch ganz besonders im Vordergrunde stehend der durch intrinsische und/oder extrinsische Faktoren gealterten oder alternden Haut sowie die Verwendung solcher Wirkstoffe und Kombinationen solcher Wirkstoffe auf dem Gebiete der kosmetischen und dermatologischen Hautpflege.

[0002] Unter kosmetischer Hautpflege ist in erster Linie zu verstehen, daß die natürliche Funktion der Haut als Barriere gegen Umwelteinflüsse (z. B. Schmutz, Chemikalien, Mikroorganismen) und gegen den Verlust von körpereigenen Stoffen (z. B. Wasser, natürliche Fette, Elektrolyte) gestärkt oder wiederhergestellt wird.

[0003] Wird diese Funktion gestört, kann es zu verstärkter Resorption toxischer oder allergener Stoffe oder zum Befall von Mikroorganismen und als Folge zu toxischen oder allergischen Hautreaktionen kommen.

[0004] Ziel der Hautpflege ist es ferner, den durch tägliches Waschen verursachten Fett- und Wasserverlust der Haut auszugleichen. Dies ist gerade dann wichtig, wenn das natürliche Regenerationsvermögen nicht ausreicht. Außerdem sollen Hautpflegeprodukte vor Umwelteinflüssen, insbesondere vor Sonne und Wind, schützen und die Hautalterung verzögern.

[0005] Die chronologische Hautalterung wird z. B. durch endogene, genetisch determinierte Faktoren verursacht. In Epidermis und Dermis kommt es alterungsbedingt z. B. zu folgenden Strukturschäden und Funktionsstörungen, die auch unter den Begriff "Senile Xerosis" fallen können:

- a) Trockenheit, Rauigkeit und Ausbildung von Trockenheitsfältchen,
- b) Juckreiz und
- c) verminderte Rückfettung durch Talgdrüsen (z. B. nach Waschen).

[0006] Exogene Faktoren, wie UV-Licht und chemische Noxen, können kumulativ wirksam sein und z. B. die endogenen Alterungsprozesse beschleunigen bzw. sie ergänzen. In Epidermis und Dermis kommt es insbesondere durch exogene Faktoren z. B. zu folgenden Strukturschäden- und Funktionsstörungen in der Haut, die über Maß und Qualität der Schäden bei chronologischer Alterung hinausgehen:

- d) Sichtbare Gefäßerweiterungen (Teleangiectasien, Cuperosis);
- e) Schläftheit und Ausbildung von Falten;
- f) lokale Hyper-, Hypo- und Fehlpigmentierungen (z. B. Altersflecken) und
- g) vergrößerte Anfälligkeit gegenüber mechanischem Stress (z. B. Rissigkeit).

[0007] Die vorliegende Erfindung betrifft insbesondere Produkte zur Pflege der auf natürliche Weise gealterten Haut, sowie der unter a), e) und g) aufgeführten Phänomene.

[0008] Produkte zur Pflege erschaffter, insbesondere gealterter Haut sind an sich bekannt. Sie enthalten z. B. Retinoide (Vitamin A-Säure und/oder deren Derivate) bzw. Vitamin A und/oder dessen Derivate. Ihre Wirkung auf die Strukturschäden ist allerdings umfangmäßig begrenzt. Darüber hinaus gibt es bei der Produktentwicklung erhebliche Schwierigkeiten, die Wirkstoffe in ausreichendem Maße gegen oxidativen Zerfall zu stabilisieren. Die Verwendung Vitamin A-säurehaltiger Produkte bedingt darüber hinaus oft starke erythematöse Hautreizungen. Retinoide sind daher nur in geringen Konzentrationen einsetzbar.

[0009] Oftmals wird mit der erschafften Haut auch eine Begleiterscheinung der Übergewichtigkeit und/oder der damit häufig einhergehenden sogenannten Cellulite verbunden.

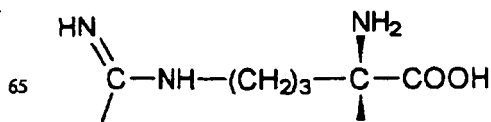
[0010] Das Körperbewußtsein der Verbraucher ist in den vergangenen Jahren deutlich gestiegen. Dabei werden neben reinigenden und pflegenden Anwendungen auch zunehmend Maßnahmen ergriffen, um die Körpersilhouette zu verbessern. Die Cellulite – ein weit verbreitetes Phänomen – nimmt dabei eine zentrale Stellung ein. Das sichtbare Bild der Cellulite beruht auf einer Zunahme von Fettpolstern in der Subcutis (Unterhautfettgewebe), einer Bindegewebsschwäche sowie einer Minderung der Durchströmungsverhältnisse in den Blut- und Lymphbahnen. Die Ursache ist somit eine zum Teil anlagebedingte Schwächung des Bindegewebes mit gleichzeitigem Auftreten von vergrößerten Fettzellkammern infolge von Übergewicht, unausgewogener Ernährung, Bewegungsmangel. Die Entstehung der Cellulite kann ferner auf eine erhöhte Durchlässigkeit der Haargefäßwände zurückgeführt werden, die das Eindringen von Wasser ins Bindegewebe erlaubt.

[0011] Daneben kann an den betroffenen Hautbereichen ein lokaler Mangel an Testosteron bestehen. Jedenfalls ist Cellulite eine Erscheinung, die fast niemals bei Männern zu beobachten ist.

[0012] Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es somit, Wege zu finden, die die Nachteile des Standes der Technik vermeiden. Insbesondere war es eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung, Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, die eine vorteilhafte Straffung erschaffter Haut bewirken können.

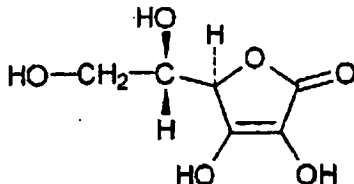
[0013] Es hat sich überraschenderweise herausgestellt, daß die Verwendung von Wirkstoffkombinationen aus Arginin und Ascorbinsäure zur Herstellung kosmetischer oder dermatologischer Zubereitungen zur Straffung der Haut den Nachteilen des Standes der Technik abhilft.

[0014] Arginin zeichnet sich durch die chemische Struktur



aus. Als halb-essentielle Aminosäure entsteht Arg im Harnstoff-Cyclus aus L-Ornithin, Carbamoylphosphat und L-Aspartat über Argininosuccinat und dient dabei der Entgiftung des Körpers von Ammoniak.

[0015] L-Ascorbinsäure {(R)-5-[(S)-1,2-Dihydroxyethyl]-3,4-dihydroxy-5-H-furan-2-on, Vitamin C} zeichnet sich durch die Strukturformel



aus. Sie ist leicht löslich in Wasser, gut löslich in Alkohol, unlöslich in Ether, Petrolether, Chloroform, Benzol sowie in Fetten u. fetten Ölen. Ascorbinsäure ist ein Endiol und wirkt als Reduktion stark reduzierend. Ascorbinsäure ist wärmeempfindlich und wird insbesondere in Gegenwart von Schwermetallspuren sowie in alkalischen Milieu durch Licht und Luftsauerstoff zersetzt, in reinem, trockenem Zustand ist sie dagegen relativ beständig gegen Licht, Luft und Wärme.

[0016] Es war indes überraschend und für den Fachmann nicht vorherzusehen, daß die Verwendung von Ascorbinsäure zur Herstellung angiogenetisch wirksamer topischer Zubereitungen, insbesondere kosmetischer und dermatologischer Zubereitungen, den Nachteilen des Standes der Technik abhelfen.

[0017] Erfindungsgemäß vorteilhaft ist insbesondere die Verwendung von Wirkstoffkombinationen aus Arginin und Ascorbinsäure zur Herstellung kosmetischer oder dermatologischer Zubereitungen zur kosmetischen und/oder dermatologischen Behandlung und/oder Prophylaxe der Cellulite.

[0018] Die Menge an Wirkstoffkombinationen Arginin in den Zubereitungen gemäß der Erfindung beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05–20 Gew.-%, insbesondere 1–10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

[0019] Die Menge an Wirkstoffkombinationen aus Ascorbinsäure in den Zubereitungen gemäß der Erfindung beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05–20 Gew.-%, insbesondere 1–10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

[0020] Bevorzugt werden die Gewichtsverhältnisse von Arginin zu Ascorbinsäure in den Wirkstoffkombinationen und Zubereitungen, solche Wirkstoffzubereitungen enthaltend, gewählt aus dem Bereich von 50 : 1 bis 1 : 50, vorteilhaft aus dem Bereich von 10 : 1 bis 1 : 50, insbesondere vorteilhaft 2 : 1 bis 1 : 2.

[0021] Es ist erfindungsgemäß insbesondere äußerst vorteilhaft, die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffkombinationen bzw. kosmetische oder topische dermatologische Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffkombinationen zur kosmetischen oder dermatologischen Behandlung oder Prophylaxe unerwünschter Hautzustände zu verwenden.

[0022] Erfindungsgemäß können Zubereitungen, welche die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen enthalten, übliche Antioxidantien eingesetzt werden.

[0023] Vorteilhaft werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z. B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z. B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z. B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z. B.  $\alpha$ -Carotin,  $\beta$ -Carotin, Lycopin) und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z. B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z. B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-,  $\gamma$ -Linoleyl-, Cholesteryl- und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z. B. Buthioninsulfoximine, Homocysteinsulfoximin, Buthioninsulfone, Penita-, Hexa-, Heptathioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z. B. pmol bis  $\mu$ mol/kg), ferner (Metall)-Chelatoren (z. B.  $\alpha$ -Hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin),  $\alpha$ -Hydroxysäuren (z. B. Citronensäure, Milchsäure, Apfelsäure), Huminsäure, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z. B.  $\gamma$ -Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Alanindiessigsäure, Flavonoide, Polyphenole, Catechine, Vitamin C und Derivate (z. B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat), Tocopherole und Derivate (z. B. Vitamin-E-acetat), sowie Koniferylbenzoat des Benzoecharzes, Rutinsäure und deren Derivate, Ferulasäure und deren Derivate, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajarsäure, Nordihydroguajarsäure, Trihydroxybutyrophennon, Harnsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Zink und dessen Derivate (z. B. ZnO, ZnSO<sub>4</sub>), Selen und dessen Derivate (z. B. Selenmethionin), Stilbene und deren Derivate (z. B. Stilbenoxid, Trans-Stilbenoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

[0024] Die Menge der Antioxidantien (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05–20 Gew.-%, insbesondere 1–10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

[0025] Die Prophylaxe bzw. die kosmetische oder dermatologische Behandlung mit dem erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoff bzw. mit den kosmetischen oder topischen dermatologischen Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfindungsgemäß verwendetem Wirkstoff erfolgt in der üblichen Weise, und zwar dergestalt, daß der erfindungsgemäß verwendete Wirkstoff bzw. die kosmetischen oder topischen dermatologischen Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfindungsgemäß verwendetem Wirkstoff auf die betroffenen Hautstellen aufgetragen wird.

[0026] Erfindungsgemäße Emulsionen im Sinne der vorliegenden Erfindung, z. B. in Form einer Crème, einer Lotion, einer kosmetischen Milch sind vorteilhaft und enthalten z. B. fette Öle, Wachse und/oder andere Fettkörper sowie Was-

# DE 101 28 910 A 1

[0027] Es ist auch möglich und vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffkombinationen in wässrige Systeme bzw. Tensidzubereitungen zur Reinigung der Haut und der Haare einzufügen.

[0028] Es ist dem Fachmann natürlich bekannt, daß anspruchsvolle kosmetische Zusammensetzungen zumeist nicht ohne die üblichen Hilfs- und Zusatzstoffe denkbar sind. Darunter zählen beispielsweise Konsistenzgeber, Füllstoffe, Parfum, Farbstoffe, Emulgatoren, zusätzliche Wirkstoffe wie Vitamine oder Proteine, Lichtschutzmittel, Stabilisatoren, Insektenrepellentien, Alkohol, Wasser, Salze, antimikrobiell, proteolytisch oder keratolytisch wirksame Substanzen usw. Mutatis mutandis gelten entsprechende Anforderungen an die Formulierung medizinischer Zubereitungen.

[0029] Medizinische topische Zusammensetzungen im Sinne der vorliegenden Erfindung enthalten in der Regel ein oder mehrere Medikamente in wirksamer Konzentration. Der Einfachheit halber wird zur sauberen Unterscheidung zwischen kosmetischer und medizinischer Anwendung und entsprechenden Produkten auf die gesetzlichen Bestimmungen der Bundesrepublik Deutschland verwiesen (z. B. Kosmetikverordnung, Lebensmittel- und Arzneimittelgesetz).

[0030] Es ist dabei ebenfalls von Vorteil, die erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffkombinationen als Zusatzstoff zu Zubereitungen zu geben, die bereits andere Wirkstoffe für andere Zwecke enthalten.

[0031] Entsprechend können kosmetische oder topische dermatologische Zusammensetzungen im Sinne der vorliegenden Erfindung, je nach ihrem Aufbau, beispielsweise verwendet werden als Hautschutzcreme, Reinigungsmilch, Sonnenschutzlotion, Nährcreme, Tages- oder Nachtcreme usw. Es ist gegebenenfalls möglich und vorteilhaft, die erfindungsgemäßen Zusammensetzungen als Grundlage für pharmazeutische Formulierungen zu verwenden.

[0032] Es ist aber auch vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindungen, solche kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen zu erstellen, deren hauptsächlichlicher Zweck nicht der Schutz vor Sonnenlicht ist, die aber dennoch einen Gehalt an UV-Schutzsubstanzen enthalten. So werden beispielsweise in Tagescremes gewöhnlich UV-A- bzw. UV-B-Filtersubstanzen eingearbeitet.

[0033] Vorteilhaft können erfindungsgemäße Zubereitungen Substanzen enthalten, die UV-Strahlung im UVB-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z. B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 10 Gew.-%, insbesondere 1 bis 6 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

[0034] Die UVB-Filter können öllöslich oder wasserlöslich sein. Als öllösliche Substanzen sind z. B. zu nennen:

- 3-Benzylidencampher und dessen Derivate, z. B. 3-(4-Methylbenzyliden)campher,
- 4-Aminobenzoesäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoesäure(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoesäureamylester;
- Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentylester;
- Ester der Salicylsäure, vorzugsweise Salicylsäure(2-ethylhexyl)ester, Salicylsäure(4-isopropylbenzyl)ester, Salicylsäurehomomenthylster;
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon;
- Ester der Benzalmalonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzalmalonsäuredi(2-ethylhexyl)ester;
- 2,4,6-Triänilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazin.

[0035] Als wasserlösliche Substanzen sind vorteilhaft:

- 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure und deren Salze, z. B. Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salze,
- Sulfonsäure-Derivate von Benzophenonen, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon-5-sulfonsäure und ihre Salze;
- Sulfonsäure-Derivate des 3-Benzylidencamphers, wie z. B. 4-(2-Oxo-3-borylidenmethyl)benzolsulfonsäure, 2-Methyl-5-(2-oxo-3-borylidenmethyl)sulfonsäure und ihre Salze.

[0036] Die Liste der genannten UVB-Filter, die erfindungsgemäß Verwendung finden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

[0037] Gegenstand der Erfindung ist auch die Kombination eines erfindungsgemäßen UVA-Filters mit einem UVB-Filter bzw. eine erfindungsgemäße kosmetische oder dermatologische Zubereitung, welche auch einen UVB-Filter enthält.

[0038] Es kann auch von Vorteil sein, in erfindungsgemäßen Zubereitungen UVA-Filter einzusetzen, die üblicherweise in kosmetischen und/oder dermatologischen Zubereitungen enthalten sind. Bei solchen Filtersubstanzen handelt es sich vorzugsweise um Derivate des Dibenzoylmethans, insbesondere um 1-(4'-ter-Butylphenyl)-3-(4'-methoxyphenyl)-propan-1,3-dion und um 1-Phenyl-3-(4'-isopropylphenyl)propan-1,3-dion. Auch Zubereitungen, die diese Kombinationen enthalten, sind Gegenstand der Erfindung. Es können die gleichen Mengen an UVA-Filtersubstanzen verwendet werden, welche für UVB-Filtersubstanzen genannt wurden.

[0039] Kosmetische und/oder dermatologische Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung können auch anorganische Pigmente enthalten, die üblicherweise in der Kosmetik zum Schutze der Haut vor UV-Strahlen verwendet werden. Dabei handelt es sich um Oxide des Titans, Zinks, Eisens, Zirkoniums, Siliciums, Mangans, Aluminiums, Cers und Mischungen davon, sowie Abwandlungen, bei denen die Oxide die aktiven Agentien sind. Besonders bevorzugt handelt es sich um Pigmente auf der Basis von Titandioxid. Es können die für die vorstehenden Kombinationen genannten Mengen verwendet werden.

[0040] Die erfindungsgemäßen kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen können kosmetische Wirk-, Hilfs- und/oder Zusatzstoffe enthalten, wie sie üblicherweise in solchen Zubereitungen verwendet werden, z. B. Antioxidationsmittel, Konservierungsmittel, Bakterizide, Parfüme, Substanzen zum Verhindern des Schäumens, Farbstoffe, Pig-

# DE 101 28 910 A 1

schen oder dermatologischen Formulierung wie Alkohole, Polyole, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte, organische Lösungsmittel oder Silikonderivate.

[0041] Sofern die kosmetische oder dermatologische Zubereitung im Sinne der vorliegenden Erfindung eine Lösung oder Emulsion oder Dispersion darstellt, können als Lösungsmittel verwendet werden:

- Wasser oder wässrige Lösungen;
- Öle, wie Triglyceride der Caprin- oder der Caprylsäure, vorzugsweise aber Rizinusöl;
- Fette, Wachse und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z. B. mit Isopropanol, Propylenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fettalkoholen mit Alkansäuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren;
- Alkohole, Diöle oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte.

[0042] Insbesondere werden Gemische der vorstehend genannten Lösungsmittel verwendet. Bei alkoholischen Lösungsmitteln kann Wasser ein weiterer Bestandteil sein.

[0043] Die Ölphase der Emulsionen, Oleogele bzw. Hydrodispersionen oder Lipodispersionen im Sinne der vorliegenden Erfindung wird vorteilhaft gewählt aus der Gruppe der Ester aus gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen, aus der Gruppe der Ester aus aromatischen Carbonsäuren und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen. Solche Esteröle können dann vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe Isopropylmyristat, Isopropylpalmitat, Isopropylstearat, Isopropyloleat, n-Butylstearat, n-Hexyllaurat, n-Decyloleat, Isocetylsteat, Isononylsteat, Isononylisononanoat, 2-Ethylhexylpalmitat, 2-Ethylhexyllaurat, 2-Hexyldecylsteat, 2-Octyldodecylpalmitat, Oleyloleat, Oleylerucat, Erucyloleat, Erucylerucat sowie synthetische, halbsynthetische und natürliche Gemische solcher Ester, z. B. Jojobaöl.

[0044] Ferner kann die Ölphase vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Kohlenwasserstoffe und -wachse, der Silikonöle, der Dialkylether, der Gruppe der gesättigten oder ungesättigten, verzweigten oder unverzweigten Alkohole, sowie der Fettsäuretriglyceride, namentlich der Triglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12-18 C-Atomen. Die Fettsäuretriglyceride können beispielsweise vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der synthetischen, halbsynthetischen und natürlichen Öle, z. B. Olivenöl, Sonnenblumenöl, Sojaöl, Erdnußöl, Rapsöl, Mandelöl, Palmöl, Kokosöl, Palmkernöl und dergleichen mehr.

[0045] Auch beliebige Abmischungen solcher Öl- und Wachskomponenten sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung einzusetzen. Es kann auch gegebenenfalls vorteilhaft sein, Wachse, beispielsweise Cetylpalmitat, als alleinige Lipidkomponente der Ölphase einzusetzen.

[0046] Vorteilhaft wird die Ölphase gewählt aus der Gruppe 2-Ethylhexylisostearat, Octyldodecanol, Isotridecylisononanoat, Isoeicosan, 2-Ethylhexylcocoat, C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat, Capryl-Caprinsäure-triglycerid, Dicaprylylether.

[0047] Besonders vorteilhaft sind Mischungen aus C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat und 2-Ethylhexylisostearat, Mischungen aus C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat und Isotridecylisononanoat sowie Mischungen aus C<sub>12-15</sub>-Alkylbenzoat, 2-Ethylhexylisostearat und Isotridecylisononanoat.

[0048] Von den Kohlenwasserstoffen sind Paraffinöl, Squalan und Squalen vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden.

[0049] Vorteilhaft kann die Ölphase ferner einen Gehalt an cyclischen oder linearen Silikonölen aufweisen oder vollständig aus solchen Ölen bestehen, wobei allerdings bevorzugt wird, außer dem Silikonöl oder den Silikonölen einen zusätzlichen Gehalt an anderen Ölphasenkomponenten zu verwenden.

[0050] Vorteilhaft wird Cyclomethicon (Octamethylcyclotetrasiloxan) als erfindungsgemäß zu verwendendes Silikonöl eingesetzt. Aber auch andere Silikonöle sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden, beispielsweise Hexamethylcyclotrisiloxan, Polydimethylsiloxan, Poly(methylphenylsiloxan).

[0051] Besonders vorteilhaft sind ferner Mischungen aus Cyclomethicon und Isotridecylisononanoat, aus Cyclomethicon und 2-Ethylhexylisostearat.

[0052] Die wässrige Phase der erfindungsgemäßen Zubereitungen enthält gegebenenfalls vorteilhaft Alkohole, Diöle oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte, ferner Alkohole niedriger C-Zahl, z. B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin sowie insbesondere ein oder mehrere Verdickungsmittel, welches oder welche vorteilhaft gewählt werden können aus der Gruppe Siliciumdioxid, Aluminiumsilikate, Polysaccharide bzw. deren Derivate, z. B. Hyaluronsäure, Xanthangummi, Hydroxypropylmethylcellulose, besonders vorteilhaft aus der Gruppe der Polyacrylate, bevorzugt ein Polyacrylat aus der Gruppe der sogenannten Carbopole, beispielsweise Carbopole der Typen 980, 981, 1382, 2984, 5984, jeweils einzeln oder in Kombination.

[0053] Übliche Grundstoffe, welche für die Verwendung als kosmetische Stoffe im Sinne der vorliegenden Erfindung geeignet sind, sind flüssige Öle (z. B. Paraffinöle, Rizinusöl, Isopropylmyristat), halbfeste Bestandteile (z. B. Vaseline, Lanolin), feste Bestandteile (z. B. Bienenwachs, Ceresin und Mikrokristalline Wachse bzw. Ozokerit) sowie hochschmelzende Wachse (z. B. Carnaubawachs, Candelillawachs).

[0054] Als Treibmittel für aus Aerosolbehältern versprühbare kosmetische und/oder dermatologische O/W-Emulsionen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind die üblichen bekannten leichtflüchtigen, verflüssigten Treibmittel, beispielsweise Kohlenwasserstoffe (Propan, Butan, Isobutan) geeignet, die allein oder in Mischung miteinander eingesetzt

# DE 101 28 910 A 1

[0055] Natürlich weiß der Fachmann, daß es an sich nichttoxische Treibgase gibt, die grundsätzlich für die Verwirklichung der vorliegenden Erfindung in Form von Aerosolpräparaten geeignet wären, auf die aber dennoch wegen bedenkllicher Wirkung auf die Umwelt oder sonstiger Begleitumstände verzichtet werden sollte, insbesondere Fluorkohlenwasserstoffe und Fluorchlorkohlenwasserstoffe (FCKW).

5 [0056] Kosmetische Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung können auch als Gele vorliegen, die neben einem wirksamen Gehalt an erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffkombinationen und dafür üblicherweise verwendeten Lösungsmitteln, bevorzugt Wasser, noch organische Verdickungsmittel, z. B. Gummiarabikum, Xanthangummi, Natriumalginat, Cellulose-Derivate, vorzugsweise Methylcellulose, Hydroxymethylcellulose, Hydroxyethylcellulose, Hydroxypropylcellulose, Hydroxypropylmethylcellulose oder anorganische Verdickungsmittel, z. B. Aluminiumsilikate wie  
10 beispielsweise Bentonite, oder ein Gemisch aus Polyethylenglykol und Polyethylenglykolestearat oder -distearat, enthalten. Das Verdickungsmittel ist in dem Gel z. B. in einer Menge zwischen 0,1 und 30 Gew.-%, bevorzugt zwischen 0,5 und 15 Gew.-%, enthalten.

[0057] Die folgenden Beispiele sollen die Erfindung erläutern, aber nicht einschränken. Die Zahlenangaben beziehen sich auf Gew.-%, sofern nichts Anderes angegeben ist.

15

## Beispiel 1

### W/O Crème

20

Gew.-%

Paraffinöl	10,00
Petrolatum	4,00
Wollwachsalkohol	1,00
PEG-7 Hydriertes Rizinusöl	3,00
25 Aluminiumstearat	0,40
Ascorbinsäure	1,00
L-Arginin	1,00
Glycerin	2,00
Wasser, Konservierungsmittel und Parfüm	ad 100,00

30

## Beispiel 2

### W/O Lotion

35

Gew.-%

Paraffinöl	20,00
Petrolatum	4,00
Glucosesequiosstearat	2,00
40 Aluminiumstearat	0,40
Ascorbinsäure	1,50
L-Arginin	3,00
Vitamin E Acetat	2,00
Vitamin C Palmitat	0,20
45 Glycerin	5,00
Wasser, Konservierungsmittel und Parfüm	ad 100,00

50

## Beispiel 3

### Lippenpflegestift

Gew.-%

Hydriertes Rizinusöl	4,00
55 Ceresin	8,00
Bienenwachs	4,00
Carnaubawachs	2,00
Petrolatum	40,00
Ascorbinsäure	2,00
60 L-Arginin	3,00
$\beta$ -Carotin	0,10
Paraffinöl, Pigmente und Farbstoffe	ad 100,00

65

# DE 101 28 910 A 1

## Beispiel 4

### Liposomenhaltiges Gel

	Gew.-%	
Lecithin	6,00	5
Schibutter	3,00	
Ascorbinsäure	2,00	
L-Arginin	2,00	
Vitamin A Palmitat	0,20	10
Biotin	0,08	
Natriumcitrat	0,50	
Glycin	0,20	
Harnstoff	0,20	
Natrium PCA	0,50	15
Hydrolysiertes Kollagen	2,00	
Xanthan Gummi	1,40	
Sorbitol	3,00	
Wasser, Konservierungsmittel und Parfüm	ad 100,00	20

## Beispiel 5

### O/W Lotion

	Gew.-%	
Paraffinöl	8,00	
Isopropylpalmitat	3,00	
Petrolatum	4,00	
Cetearylalkohol	2,00	30
PEG-40 Rizinusöl	0,50	
Natriumcetearylsulfat	0,50	
Natrium Carbomer	0,40	
Ascorbinsäure	2,00	
L-Arginin	0,50	35
Deferoxamin	0,50	
Glycerin	3,00	
$\alpha$ -Tocopherol	0,20	
Octylmethoxycinnamat	5,00	
Butylmethoxydibenzoylmethan	1,00	40
Wasser, Konservierungsmittel und Parfüm	ad 100,00	

## Beispiel 6

### O/W Crème

	Gew.-%	
Paraffinöl	7,00	
Avocadoöl	4,00	50
Glycerylmonostearat	2,00	
Natriumstearat	1,00	
Phytinsäure	0,80	
Deferoxamin	0,20	
Ascorbinsäure	1,00	55
L-Arginin	0,50	
$\alpha$ -Hydroxypalmitinsäure	0,30	
Titandioxid	1,00	
Natriumlactat	3,00	
Glycerin	3,00	60
Wasser, Konservierungsmittel und Parfüm	ad 100,00	

# DE 101 28 910 A 1

## Beispiel 7

### Haarkur

	Gew.-%
5 Paraffinöl	3,00
Mandelöl	3,00
Cetostearylalcohol	5,00
PEG-40 Rizinusöl	1,00
10 Natriumcetearylsulfate	0,50
Sorbitol	5,00
Glycerin	5,00
Ascorbinsäure	0,50
L-Arginin	1,00
15 Dilaurylthiodipropionat	0,05
Wasser, Konservierungsmittel und Parfüm	ad 100,00

## Beispiel 8

### Massagecrème

	Gew.-%
20 Stearylalkohol	2,00
25 Petrolatum	4,00
Dimethicon	2,00
Isopropylpalmitat	6,00
Cetearylalkohol	4,00
PEG-40 Hydriertes Rizinusöl	2,00
30 Ascorbinsäure	0,50
L-Arginin	1,00
Glycerin	3,00
Wasser, Konservierungsmittel und Parfüm	ad 100,00

## Patentansprüche

1. Verwendung von Wirkstoffkombinationen aus Arginin und Ascorbinsäure zur Herstellung kosmetischer oder dermatologischer Zubereitungen zur Straffung und/oder Festigung der Haut.
2. Verwendung nach Anspruch 1 zur kosmetischen und/oder dermatologischen Behandlung und/oder Prophylaxe der Cellulite.
3. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß die Menge an Arginin in den Zubereitungen 0,001 bis 30 Gew.-% beträgt, besonders bevorzugt 0,05-20 Gew.-%, insbesondere 1-10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.
4. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß die Menge an Ascorbinsäure in den Zubereitungen 0,001 bis 30 Gew.-% beträgt, besonders bevorzugt 0,05-20 Gew.-%, insbesondere 1-10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.
5. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß Gewichtsverhältnisse von Arginin zu Ascorbinsäure in den Wirkstoffkombinationen und Zubereitungen, solche Wirkstoffzubereitungen enthaltend, gewählt werden aus dem Bereich von 50 : 1 bis 1 : 50, vorteilhaft aus dem Bereich von 10 : 1 bis 1 : 50, insbesondere vorteilhaft 2 : 1 bis 1 : 2.